

**PRIORITY
DOCUMENT**

SUBMITTED OR TRANSMITTED IN
COMPLIANCE WITH RULE 17.1(a) OR (b)



EP03/12097

REC'D 16 DEC 2003	
WIPO	PCT

**Prioritätsbescheinigung über die Einreichung
einer Gebrauchsmusteranmeldung**

Aktenzeichen:

202 17 814.5

Anmeldetag:

18. November 2002

Anmelder/Inhaber:

ASAT AG Applied Science & Technology,
Zug/CH

Bezeichnung:

Melatonin-Tagesdosierungseinheiten

IPC:

A 61 J, A 61 K, B 65 D

Die angehefteten Stücke sind eine richtige und genaue Wiedergabe der ursprünglichen Unterlagen dieser Gebrauchsmusteranmeldung.

München, den 27. Januar 2003
Deutsches Patent- und Markenamt
Der Präsident

Im Auftrag

Fausel

WEICKMANN & WEICKMANN

Patentanwälte
European Patent Attorneys · European Trademark Attorneys

DIPL.-ING. H. WEICKMANN (bis 31.1.01)
DIPL.-ING. F. A. WEICKMANN
DIPL.-CHEM. B. HUBER
DR.-ING. H. LISKA
DIPL.-PHYS. DR. J. PRECHTEL
DIPL.-CHEM. DR. B. BOHM
DIPL.-CHEM. DR. W. WEISS
DIPL.-PHYS. DR. J. TIESMEYER
DIPL.-PHYS. M. HERZOG
DIPL.-PHYS. B. RUTTENSPERGER
DIPL.-PHYS. DR.-ING. V. JORDAN
DIPL.-CHEM. DR. M. DEY
DIPL.-FORSTW. DR. J. LACHNIT

Unser Zeichen:
29276G DE/WWCGei

Anmelder:
ASAT AG
Applied Science & Technology
Baarerstrasse 77

6302 Zug
Schweiz

Melatonin-Tagesdosierungseinheiten

BEST AVAILABLE COPY

Melatonin-Tagesdosierungseinheiten

Beschreibung

5

Die vorliegende Erfindung betrifft einen Einwegbehälter für ein Arzneimittel oder kosmetisches Mittel zur topischen Applikation, enthaltend eine Einzeldosis an Melatonin oder einem Melatonin-Derivat, die einer lokal wirksamen Dosis entspricht, die aber keine systemische Wirkung hervorruft.

10

Melatoninhaltige Mittel können für unterschiedliche medizinische und kosmetische Zwecke verwendet werden. Das Dokument DE 101 10 418.9 offenbart beispielsweise melatoninhaltige Zusammensetzungen für eine topische Anwendung auf der Haut und im Haar.

15

Der Gegenstand der vorliegenden Erfindung betrifft einen Einwegbehälter für ein Arzneimittel oder kosmetisches Mittel zur topischen Applikation, enthaltend eine Einzeldosis an Melatonin oder einem Melatonin-Derivat, die einer lokal wirksamen Dosis entspricht, die aber keine systemische Wirkung hervorruft.

20

Der erfindungsgemäße Einwegbehälter ermöglicht die Applikation einer Dosis an Melatonin oder einem Melatonin-Derivat, die lokal wirksam ist, jedoch keine unerwünschte Veränderung des normalen Melatoninplasmaspiegels verursacht. Die erfindungsgemäß applizierte Einzeldosis an Melatonin oder einem Melatonin-Derivat verursacht beispielsweise keine signifikante Erhöhung des Melatoninplasmaspiegels.

25

Der Begriff "Melatonin oder Melatonin-Derivat", wie er im Rahmen dieser Anmeldung verwendet wird, umfasst Melatonin oder/und Melatonin-

30

Derivate sowie Salze, Ester oder Komplexverbindungen davon. Bevorzugte Melatonin-Derivate umfassen beispielsweise 5-Methoxytryptamin, 5-Methoxytryptophan, 5-Methoxytryptophol, 5-Methoxyindol-3-Essigsäure und 6-Hydroxymelatonin.

5

Die erfindungsgemäße Einzeldosis stellt eine Dosis dar, welche eine positive kosmetische oder/und therapeutische Wirkung ohne signifikante Veränderungen des Plasmaspiegels ermöglicht. Erfindungsgemäß bevorzugt ist eine Einzeldosis von etwa 0,001 bis etwa 1,0 mg Melatonin, mehr
10 bevorzugt eine Einzeldosis von etwa 0,01 bis etwa 0,2 mg Melatonin. Je nach Anwendungsbereich bzw. Verwendungszweck des Mittels kann ein oder mehrmals täglich eine Einzeldosis appliziert werden. In einer bevorzugten Ausführungsform entspricht die Einzeldosis einer Tagesdosis, besonders bevorzugt einer abends anzuwendenden Tagesdosis.

15

Das Arzneimittel oder kosmetische Mittel liegt bevorzugt als flüssige Formulierung vor. Für eine topische Applikation des Mittels sind beispielsweise Lösungen, Suspensionen, Emulsionen, Mikroemulsionen, Nanosysteme, Cremes, Gele, Lotionen, Sprays, Schäume oder Salben
20 geeignet sowie jede andere Formulierung, welche topisch appliziert werden kann. Besonders bevorzugt liegt das Mittel in Form einer kosmetischen Lösung vor.

25

Das Arzneimittel oder kosmetische Mittel, welches im erfindungsgemäßen Einwegbehälter enthalten ist, kann, je nach Verwendungszweck, verschiedene Konzentrationen an Melatonin oder einem Melatonin-Derivat aufweisen. Bevorzugt enthält das Mittel eine Konzentration von etwa 0,001 bis etwa 0,01 % (Gew.), mehr bevorzugt von etwa 0,003 bis 0,004 % (Gew.) an Melatonin oder einem Melatonin-Derivat. Eine besonders
30 bevorzugte Konzentration beträgt etwa 0,0033 % (Gew.).

In einer Ausführungsform enthält das therapeutische oder kosmetische Mittel Melatonin oder ein Melatonin-Derivat als einzigen Wirkstoff. Das Mittel kann darüber hinaus jedoch zusätzlich einen oder mehrere weitere Wirkstoffe enthalten, wie etwa Vitamin A, Vitamin A-Säure oder andere Vitamin A-Derivate, Biotin oder/und Gingko Biloba.

In einer bevorzugten Ausführungsform enthält das Arzneimittel oder kosmetische Mittel eine Kombination der Wirkstoffe Melatonin oder Melatonin-Derivat mit Biotin oder/und Gingko Biloba. Die Wirkstoffe in dieser Ausführungsform können in verschiedenen Dosierungen vorliegen. Eine besonders bevorzugte Dosierung dieser Kombination beträgt von etwa 0,05 bis etwa 0,2 mg, besonders bevorzugt etwa 0,1 mg Melatonin oder Melatonin-Derivat, von etwa 0,2 bis etwa 0,4 mg, besonders bevorzugt etwa 0,3 mg Biotin sowie von etwa 1,3 bis etwa 1,7 mg, besonders bevorzugt etwa 1,5 mg Gingko Biloba. Gingko Biloba kann hierbei beispielsweise als Extrakt, insbesondere als Trockenextrakt oder/und in Form einer oder mehrerer Inhaltsstoffe enthalten sein.

In einer weiteren bevorzugten Ausführungsform enthält das Mittel eine Kombination der Wirkstoffe Melatonin oder Melatonin-Derivat und Vitamin A, Vitamin A-Säure oder einem anderen Derivat des Vitamins A. In dieser bevorzugten Wirkstoffkombination beträgt die Dosierung von Melatonin oder Melatonin-Derivat bevorzugt von etwa 0,05 bis 0,2 mg, besonders bevorzugt etwa 0,1 mg Melatonin.

Weiterhin kann das Arzneimittel oder kosmetische Mittel einen oder mehrere kosmetische oder/und pharmazeutische Hilfs- bzw. Zusatzstoffe enthalten, wie beispielsweise Verdickungsmittel, Mineralstoffe oder Duftstoffe.

Der erfindungsgemäße Einwegbehälter kann je nach beabsichtigter Applikation bzw. Verwendungszweck unterschiedliche Volumina des

Arzneimittels oder kosmetischen Mittels enthalten. In einer bevorzugten Ausführungsform enthält der Einwegbehälter etwa 2,5 bis etwa 3,5 ml, bevorzugt etwa 2,9 bis etwa 3,2 ml des Mittels. Ein besonders bevorzugtes Volumen beträgt etwa 3,0 ml.

5

Das therapeutische oder kosmetische Mittel kann durch jedes geeignete Verfahren, das im Stand der Technik bekannt ist, abgefüllt sein. Bevorzugt ist das Mittel unter GMP-Bedingungen abgefüllt. Dadurch kann gewährleistet werden, dass das Mittel steril ist und sich bei einer Applikation des Mittels keine Probleme etwa im Hinblick auf bakterielle Kontamination ergeben.

10

Der erfindungsgemäße Einwegbehälter kann im Wesentlichen aus jedem beliebigen Material bestehen. Bevorzugte Materialien sind beispielsweise Kunststoffe bzw. Gemische aus Kunststoffen. Besonders geeignete Kunststoffe sind beispielsweise Polyethylen, Polyvinylchlorid, Polystyrol oder Polypropylen, besonders bevorzugt ist Polyethylen.

15

Der Einwegbehälter kann je nach erwünschter optischer Erscheinung transparent, nicht transparent, farblos oder farbig sein. Dem Kunststoff können beispielsweise beliebige Farbstoffe beigemischt sein, um einen farbigen Behälter zu erhalten. Ein nicht transparenter Behälter wird bevorzugt dann verwendet, wenn das Mittel lichtempfindliche Substanzen enthält, da durch einen nicht transparenten Behälter zudem ein Lichtschutz erzielt werden kann.

20

25

Der erfindungsgemäße Einwegbehälter kann eine im Wesentlichen beliebige Form aufweisen. Beispiele für bevorzugte Behälter sind in den Figuren 1 und 2 veranschaulicht. Bevorzugt umfasst ein geeigneter Einwegbehälter einen Teil, in welchem das Mittel enthalten ist, und einen Einwegverschluss, welcher durch eine Sollbruchstelle mit dem unteren Teil verbunden ist.

30

Vorteilhafterweise wird eine einfache und sichere Handhabung bei der Verwendung des Behälters dadurch gewährleistet, dass er bevorzugt einen durch Drehen zu öffnenden Einwegverschluss an seinem Kopf aufweist. Somit kann der Behälter leicht geöffnet werden. Darüber hinaus kann das Mittel nach Öffnen nur bei Anwendung von Druck austreten. Dieser Druck kann beispielsweise beim Auftragen durch die Hand angewendet werden. Diese Eigenschaft ermöglicht es dem Anwender, das Mittel gezielt zu platzieren und gut zu dosieren. Wenn eine Applikation des Mittels auf die Kopfhaut bzw. die Haare erfolgen soll, kann der geöffnete Behälter wie ein Kamm direkt durch die Haare geführt werden. Dies ermöglicht eine leichte und sichere Handhabung des Behälters sowie eine richtige Dosierung des Mittels.

Je nach Verwendungszweck ist der Einwegbehälter durch eine Prägung oder Bedruckung beschriftet oder/und mit einem Etikett versehen.

Zwei oder mehrere Einwegbehälter können weiterhin miteinander trennbar verbunden sein. Bevorzugt sind 5 oder 10 Behälter miteinander verbunden und bilden eine Anordnung. Weiterhin kann ein Behälter oder eine Anordnung von Behältern verpackt sein, bevorzugt in eine lichtdichte Verpackung, besonders bevorzugt beispielsweise in einen Aluminiumbeutel.

Mit dem Begriff "Aluminiumbeutel" wie er hierin verwendet wird, sind sowohl Beutel aus Aluminium als auch Beutel, welche beispielsweise an der Außen- oder Innenfläche mit Aluminium beschichtet sind, umfasst. Beispielsweise können Beutel aus einer oder mehreren Schichten von Kunststoff oder/und Papier mit Aluminium beschichtet sein. Ein bevorzugter Beutel umfasst z.B. eine Aluminium enthaltende, laminierte Folie, welche zusätzlich Polyethylen, Polyester oder/und Papier umfasst.

Eine Verpackung, insbesondere eine lichtdichte Verpackung, ermöglicht eine Lagerung über einen längeren Zeitraum, ohne Verlust der Wirksamkeit

des Mittels. Weiterhin kann eine solche Verpackung einen Schutz vor Gasverlust bereitstellen.

5 Je nach Verwendungszweck kann ein Aluminiumbeutel, in welchen ein oder mehrere Einwegbehälter verpackt sind, bedruckt oder/und mit einem Etikett versehen sein.

10 In einer weiteren Ausführungsform der Erfindung wird eine Verpackungseinheit, die mehrere Anordnungen von Einwegbehältern umfasst, bereitgestellt.

Die Erfindung wird weiterhin durch die beiliegenden Figuren 1 und 2 erläutert.

15 **Fig. 1** zeigt eine Anordnung von 5 trennbar verbundenen Einwegbehältern, welche eine bevorzugte Gestaltung aufweisen.

20 **1 A** zeigt eine Vorderansicht, **1 B** eine Draufsicht, **1 C** eine Seitenansicht und **1 D** eine perspektive Ansicht schräg von oben.

Fig. 2 A zeigt eine Vorderansicht eines einzelnen Einwegbehälters mit bevorzugter Gestaltung.

25 **2 B** zeigt eine Vorderansicht einer Anordnung von 10 trennbar verbundenen Einwegbehältern, **2 C** zeigt eine Seitenansicht und **2 D** eine Draufsicht derselben Anordnung.

Ansprüche

- 5 1. Einwegbehälter für ein Arzneimittel oder kosmetisches Mittel zur topischen Applikation, enthaltend eine Einzeldosis an Melatonin oder einem Melatonin-Derivat, die einer lokal wirksamen Dosis entspricht, die aber keine systemisch Wirkung hervorruft.
- 10 2. Behälter nach Anspruch 1,
dadurch gekennzeichnet,
dass die Einzeldosis von 0,001 - 1,0 mg Melatonin oder Melatonin-Derivat beträgt.
- 15 3. Behälter nach Anspruch 1 oder 2,
dadurch gekennzeichnet,
dass die Einzeldosis von 0,01 - 0,2 mg Melatonin oder Melatonin-Derivat beträgt.
- 20 4. Behälter nach einem der Ansprüche 1 bis 3,
dadurch gekennzeichnet,
dass die Einzeldosis einer Tagesdosis entspricht.
- 25 5. Behälter nach einem der Ansprüche 1 bis 4,
dadurch gekennzeichnet,
dass das Mittel als flüssige Formulierung vorliegt.
- 30 6. Behälter nach Anspruch 5,
dadurch gekennzeichnet,
dass die flüssige Formulierung eine Konzentration von 0,001 - 0,01 % (Gew.) an Melatonin aufweist.

7. Behälter nach Anspruch 6,
dadurch gekennzeichnet,
dass die flüssige Formulierung eine Konzentration von 0,003 - 0,004
% (Gew.) an Melatonin aufweist.

5

8. Behälter nach einem der vorherigen Ansprüche,
dadurch gekennzeichnet,
dass das Mittel als einzigen Wirkstoff Melatonin oder ein Melatonin-
Derivat enthält.

10

9. Behälter nach einem der Ansprüche 1 bis 7,
dadurch gekennzeichnet,
dass das Mittel als Wirkstoffe eine Kombination von Melatonin oder
einem Melatonin-Derivat mit Biotin oder/und Gingko Biloba enthält.

15

10. Behälter nach einem der Ansprüche 1 bis 7,
dadurch gekennzeichnet,
dass das Mittel als Wirkstoff eine Kombination von Melatonin oder
einem Melatonin-Derivat und Vitamin A, Vitamin A-Säure oder einem
anderen Derivat des Vitamins A enthält.

20

11. Behälter nach einem der vorhergehenden Ansprüche,
dadurch gekennzeichnet,
dass er 2,5 - 3,5 ml des Mittels enthält.

25

12. Behälter nach Anspruch 11,
dadurch gekennzeichnet,
dass er 2,9 - 3,2 ml des Mittels enthält.

30

13. Behälter nach einem der vorhergehenden Ansprüche,
dadurch gekennzeichnet,
dass das Mittel unter GMP-Bedingungen abgefüllt ist.
- 5 14. Behälter nach einem der vorliegenden Ansprüche,
dadurch gekennzeichnet,
dass er aus einem Kunststoff besteht.
- 10 15. Behälter nach Anspruch 14,
dadurch gekennzeichnet,
dass er aus Polyethylen, Polypropylen, Polyvinylchlorid, Polystyrol
oder einem Gemisch daraus besteht.
- 15 16. Behälter nach einem der Ansprüche 1 bis 15,
dadurch gekennzeichnet,
dass er farblos ist.
- 20 17. Behälter nach einem der Ansprüche 1 bis 15,
dadurch gekennzeichnet,
dass er farbig ist.
- 25 18. Behälter nach einem der Ansprüche 1 bis 17,
dadurch gekennzeichnet,
dass er transparent ist.
19. Behälter nach einem der Ansprüche 1 bis 17,
dadurch gekennzeichnet,
dass er nicht transparent ist.
- 30 20. Behälter nach einem der vorherigen Ansprüche,
dadurch gekennzeichnet,

dass er einen durch Drehen zu öffnenden Einwegverschluss an seinem Kopf aufweist.

- 5 21. Behälter nach einem der vorherigen Ansprüche,
dadurch gekennzeichnet,
dass nach Öffnen das Mittel nur bei Anwendung von Druck austritt.
- 10 22. Behälter nach einem der vorherigen Ansprüche,
dadurch gekennzeichnet,
dass er durch Bedruckung oder Prägung beschriftet ist oder/und mit
einem Etikett versehen ist.
- 15 23. Anordnung von mehreren miteinander trennbar verbundenen
Behältern nach einem der Ansprüche 1 bis 22.
- 20 24. Anordnung nach Anspruch 23,
dadurch gekennzeichnet,
dass 5 Behälter miteinander trennbar verbunden sind.
- 25 25. Anordnung nach Anspruch 23,
dadurch gekennzeichnet,
dass 10 Behälter miteinander trennbar verbunden sind.
- 26 26. Anordnung nach einem der Ansprüche 23 bis 25,
dadurch gekennzeichnet,
dass sie in einen Aluminiumbeutel verpackt ist.
- 30 27. Anordnung nach Anspruch 26,
dadurch gekennzeichnet,
dass der Beutel aus einer Aluminium enthaltenden lamierten Folie
besteht und zusätzlich Polyethylen, Polyester oder/und Papier
umfasst.

28. Anordnung nach Anspruch 26 oder 27,
dadurch gekennzeichnet,
dass der Aluminiumbeutel bedruckt ist oder/und mit einem Etikett
versehen ist.

5

29. Verpackungseinheit, umfassend mehrere Anordnungen nach einem
der Ansprüche 23 bis 28.

Zusammenfassung

Die vorliegende Erfindung betrifft einen Einwegbehälter für ein Arzneimittel
5 oder kosmetisches Mittel zur topischen Applikation, enthaltend eine
Einzeldosis an Melatonin oder einem Melatonin-Derivat, die einer lokal
wirksamen Dosis entspricht, die aber keine systemische Wirkung
hervorruft.

10

ei 18.11.2002

1/2

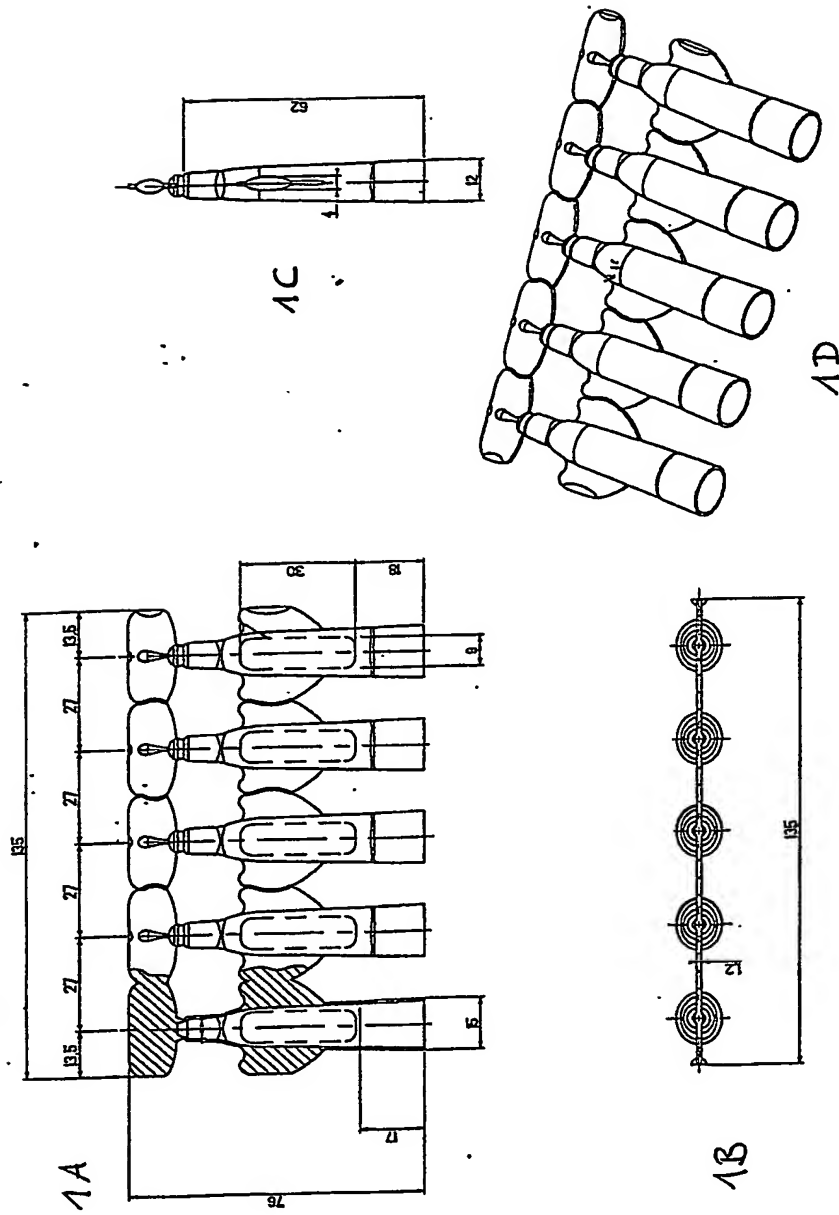
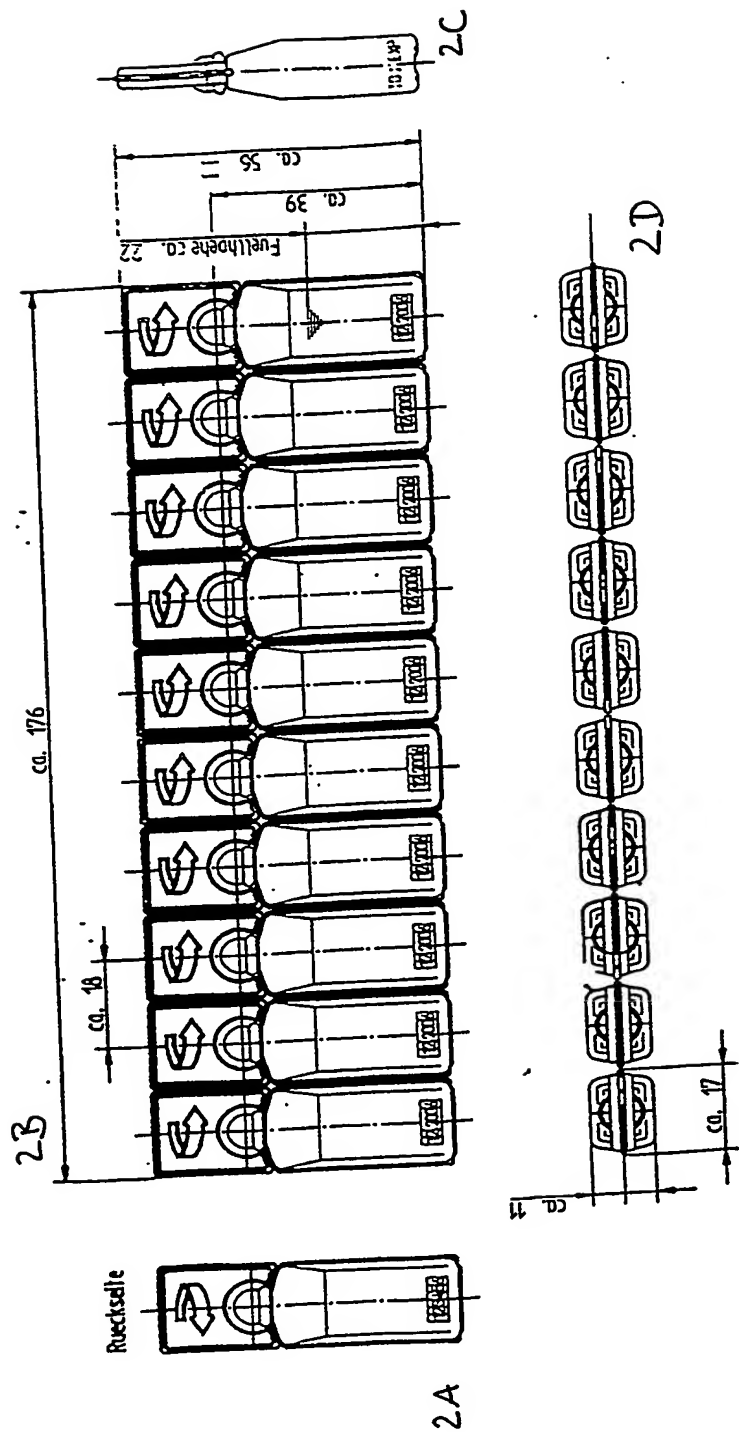


Figure 1



Figur 2